DIALOG(R) File 351: Derwent WPI (c) 2001 Derwent Info Ltd. All rts. reserv. 009611891 WPI Acc No: 1993-305439/\*199339\* XRAM Acc No: C93-135866 Antiacne compsns. - contain piroctone olamine, pyrithione zinc, and a collagenfatty acid deriv. Patent Assignee: LAB BIORGA SA (BIOR-N) Inventor: MARTIN H; VALETTE L Number of Countries: 001 Number of Patents: 001 Patent Family: Patent No Kind Date Applicat No Kind Date Week FR 2685638 A1 19930702 FR 9116406 19911231 199339 B Priority Applications (No Type Date): FR 9116406 A 19911231 Patent Details: Patent No Kind Lan Pg Main IPC Filing Notes FR 2685638 A1 11 A61K-031/44 Abstract (Basic): FR 2685638 A Compsns. comprising piroctone olamine (I), pyrithione zinc (II), and an anionic surfactant derived from collagen and a fatty acid (III), The compsns. pref. also contain an anti-oxidant, esp. a micro-emulsion of Vitamin E. They may also contain antifungal, antiseptic, and anti-seborrhetic agents. The pref. compsns. contain 0.05-2% by weight of (I), 0.1-3% of (II) and 5-10% of (III). The amt. of Vitamin E that may be present is usually between 0.5 and 10%. The compsns. may be formulated as creams, pomades, lotions, powders, soaps, etc. The presence of humectants, hydrating agents, perfumes, dyes etc. is also described. USE/ADVANTAGE - Treatment of acne. The compsns. are active against the various factors that contribute to the presence of acne, in particular the proliferation of Pityrosporum ovale, which plays an important role in its pathogenesis Dwg.0/0 Title Terms: ANTI; ACNE; COMPOSITION; CONTAIN; PYRITHIONE; ZINC; COLLAGEN; FATTY; ACID; DERIVATIVE Derwent Class: B05; D21; E19 International Patent Class (Main): A61K-031/44 International Patent Class (Additional): A61K-007/48; A61K-009/107 File Segment: CPI Manual Codes (CPI/A-N): B03-H; B05-A03A; B07-D04C; B12-A07; B12-G07; D08-B09A; E05-L03D; E10-A03 Chemical Fragment Codes (M1): \*03\* J0 J011 J3 J371 M423 M431 M782 M903 P943 V752 Chemical Fragment Codes (M2):
\*01\* F011 F012 F432 H2 H211 J5 J592 J9 K0 K8 K850 L9 L943 M280 M320 M413 M431 M510 M521 M530 M540 M630 M782 M903 M904 M910 P943 R03152-M \*02\* F011 F012 F016 F432 H2 H211 J5 J521 K0 K8 K850 L9 L941 M220 M222 M233 M240 M281 M320 M413 M431 M510 M521 M530 M540 M630 M782 M903 M904 P943 9339-09301-M Chemical Fragment Codes (M3): \*01\* F011 F012 F432 H2 H211 J5 J592 J9 K0 K8 K850 L9 L943 M280 M320 M413 M431 M510 M521 M530 M540 M630 M782 M903 M904 M910 P943 R03152-M \*02\* F011 F012 F016 F432 H2 H211 J5 J521 K0 K8 K850 L9 L941 M220 M222 M233 M240 M281 M320 M413 M431 M510 M521 M530 M540 M630 M782 M903 M904 P943 9339-09301-M Derwent Registry Numbers: 1487-U Specific Compound Numbers: R03152-M

Generic Compound Numbers: 9339-09301-M

19 RÉPUBLIQUE FRANÇAISE

(12)

## INSTITUT NATIONAL DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE

**PARIS** 

(à n'utiliser que pour les commandes de reproduction)

2 685 638

21 N° d'enregistrement national :

91 16406

(51) Int CI<sup>5</sup>: A 61 K 31/44, 7/48, 9/107

RGA (S.A.) —
ouis.
-

DEMANDE DE BREVET D'INVENTION

Compositions pour l'usage cosmétique et/ou dermatologique, comprenant une association de pyrithione zinc, de piroctone olamine, et d'un dérivé de collagène et d'acide gras.

(74) Mandataire : Cabinet Ores.

57) L'Invention est relative à une composition pour l'usage cosmétique et/ou dermatologique, laquelle composition est caractérisée en ce qu'elle comprend de la piroctone olamine, de la pyrithione zinc, un dérivé de collagène et d'acide gras, et éventuellement un antioxydant, de préférence la vitamine E.

La composition conforme à l'Invention est avantageusement utilisée pour l'hygiène et les soins des peaux acnéiques.





La présente invention est relative à des compositions pour l'usage cosmétique et/ou dermatologique, plus particulièrement destinées à l'hygiène et au soin des peaux acnéiques, lesquelles compositions contiennent en tant que principe actif, une association de piroctone olamine et de pyrithione zinc. Les peaux acnéiques résuld'une association de plusieurs composantes. départ existe une hypersécrétion sébacée, accompagnée d'une dyskératinisation qui induit, au niveau des glandes sébacées, une rétention de sébum, provoquant la formation de comédons. La glande sébacée engorgée est un lieu propice à la prolifération de microorganismes Propionibacterium acnes, le staphylocogue, Pytirosporum ovale. A ceci viennent s'ajouter une irritation puis une inflammation déclenchées par de nombreux 15 facteurs, notamment par la présence d'acides gras libres qui subissent des oxydations et peroxydations, entraînant la formation de radicaux libres, générateurs de phénomènes inflammatoires. L'ensemble de ces phénomènes entraîne la formation des pustules caractéristiques de 20 l'acné.

Les traitements antiacnéiques classiques associent généralement l'utilisation, d'une part, d'antibiotiques et d'antiseptiques, agissant sur la composante infectieuse, et d'autre part, de kératolytiques, agissant sur la rétention de sébum.

En ce qui concerne la composante infectieuse, les traitements antibiotiques et antiseptiques préconisés ont essentiellement pour but la diminution de la flore bactérienne, généralement considérée comme responsable de la surinfection des glandes sébacées. Toutefois, la diminution de la flore bactérienne ainsi provoquée entraîne la prolifération de Pityrosporum ovale. Or, il semble que l'infection par Pityrosporum ovale joue également un rôle important dans la pathogenèse de l'acné, et en particulier dans le déclenchement du processus inflammatoire;

ce microorganisme est en effet en grande partie responsable des oxydations et peroxydations des acides gras accumulés dans les glandes sébacées.

En ce qui concerne la rétention de sébum, les kératolytiques permettent la dissolution du bouchon sébacé; ils provoquent toutefois un amincissement de la couche cornée, ce qui entraîne une déshydratation et un dessèchement de la peau, et une augmentation de sa sensibilité aux agressions d'origines diverses. Cet état est en outre accentué par l'effet irritant de certains des traitements antiseptiques locaux associés, et parfois par des produits d'hygiène trop agressifs, qui, sous prétexte d'éliminer l'excès de sébum, conduisent à la délipidation de l'épiderme.

La présente Invention a pour but de pourvoir à un produit de soin et de traitement des peaux acnéiques, actif au niveau de différents facteurs responsables de la composante inflammatoire de l'acné.

L'Inventeur a constaté que des compositions 20 comprenant une association de pyrithione zinc, de piroctone olamine, en combinaison avec un agent tensio-actif amionique, dérivé de collagène et d'acide gras, étaient particulièrement actives pour prévenir la prolifération de *Pityrosporum ovale*.

La présente invention a pour objet une composition pour l'usage cosmétique et/ou dermatologique, caractérisée en ce qu'elle comprend, en tant que principe actif, une association de piroctone olamine et de pyrithione zinc, et d'un tensio-actif amionique dérivé de 30 collagène et d'acide gras..

Selon un mode de réalisation préféré d'une composition conforme à l'invention, ladite composition comprend en outre au moins un agent antioxydant.

En effet, l'adjonction d'au moins un agent 35 antioxydant à une composition conforme à l'invention, augmente l'activité anti-irritante et anti-inflammatoire

de ladite composition.

De manière générale, tous les agents antioxydants piégeant les radicaux libres, permettant d'éviter l'oxydation et la peroxydation des acides gras et compatibles avec une formulation destinée à l'usage dermatologique et/ou cosmétique peuvent être employés. Il est possible de citer, par exemple, et de façon non limitative, la vitamine E et ses dérivés, la vitamine A, la vitamine C, et leurs dérivés, la superoxyde dismutase, l'allopurinol, la cystéine, les flavophérols, les dérivés quinoniques, l'extrait de Gingko biloba, butylhydroxytoluène, le sélénium, etc...

De manière avantageuse, l'agent anti-oxydant est la vitamine E, sous forme de micro-émulsion.

Selon un mode de réalisation préféré d'une composition conforme à l'invention, elle comprend entre 0,05 et 2%, en poids, de piroctone olamine, entre 0,1 et 3%, en poids, de pyrithione zinc, et entre 5 et 20 %, en poids, de dérivé de collagène et d'acide gras.

De façon avantageuse, elle comprend en outre de 0,5 à 10%, en poids, de vitamine E.

La piroctone olamine et la pyrithione zinc peuvent également être associées à d'autres antifongiques, antiseptiques et/ou antiséborrhéiques, par exemple des dérivés imidazolés, des dérivés iodés, 25 dérivés de sélénium, des sels d'undécylénate, des esters d'acide parahydroxybenzoïque, des ammoniums quaternaires, des alcools, l'acide lactique, l'acide borique, la chlorhexidine, l'héxétidine, le soufre, les acides aminés soufrés, les goudrons, des extraits végétaux tels que les 30 extraits d'ortie, de bouleau, d'hamamélis, ainsi que des vitamines A, H, B6.

Les compositions conformes à l'Invention permettent la préparation d'un grand nombre de produits destinés à l'usage cosmétique et/ou dermatologique, tels que des crèmes, pommades, lotions, poudres, savons,

etc... Lorsque l'association piroctone olamine/pyrithione zinc est utilisée dans des préparations destinées à demeurer sur la peau, telles que des crèmes, on choisira de préférence dans les gammes mentionnées plus haut, les plus faibles concentrations en principes actifs ; lorsqu'il s'agit de préparation destinées à être rincées, telles que des savons, on choisira des concentrations plus importantes.

Dе manière avantageuse, les compositions 10 conformes à l'Invention sont utilisées pour l'obtention d'un savon dont la composition comprend en outre une base lavante, au moins un agent humectant et/ou hydratant, au surgraissant, agent et, optionnellement, d'autres principes actifs antifongiques, antiseptiques et/ou antiséborrhéiques, des parfums, colorants, agents 15 de texture, et conservateurs appropriés.

Les bases lavantes pouvant être utilisées sont constituées d'un ou plusieurs tensio-actifs anioniques, ou d'un ou plusieurs tensio-actifs cationiques, et/ou d'un ou plusieurs tensio-actifs amphotères, la pyrithione zinc formant des complexes avec les tensio-actifs non ioniques; de préférence seront utilisés des tensio-actifs doux, afin d'éviter une délipidation trop importante de l'épiderme.

...

Parmi les agents humectants et/ou hydratants utilisables dans le cadre de la présente invention, on peut citer : le pidolate de sodium, l'urée, le sorbitol, le glycérol, le N.M.F., les glycosaminoglycannes, le lactate de sodium, les protéines du lait, les sels de guani-dine, le collagène, le propylène glycol.

Comme agents surgraissants, on peut utiliser par exemple des dérivés d'huiles végétales, animales, ou minérales, ainsi que des huiles de synthèse ; la partie hydrophobe de certains tensio-actifs joue également le 35 rôle d'agent surgraissant.

De façon avantageuse, le pH du savon obtenu

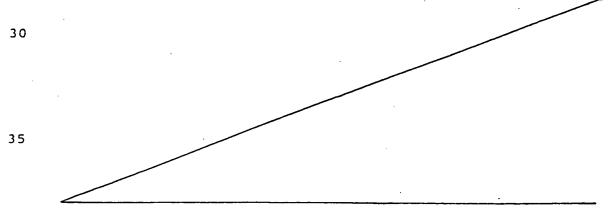
est compris entre 4 et 7. Il est possible d'utiliser, dans ce but, de l'acide borique, de l'acide sorbique, ou de l'acide citrique.

Un savon liquide conforme à la présente inven-5 tion comprend, avantageusement, entre 0,5 et 2% en poids de pyrithione zinc, entre 0,3 et 1% en poids de piroctone olamine, entre 5 et 20 %, en poids, de dérivé de collagène et d'acide gras, entre 0,5 et 20 % en poids de vitamine E, entre 1 et 10% en poids d'agents sur-10 graissants, entre 1 et 10% en poids d'agents hydratants, entre 10 et 40% en poids de tensio-actifs anioniques et/ou de tensio-actifs amphotères doux.

Ce gel nettoyant convient particulièrement pour l'hygiène des peaux acnéiques. En effet, outre les effets antifongiques et antiséborrhéiques de l'association piroctone olamine/pyrithione zinc, et l'action antioxydante de la vitamine E, la formulation de ce gel permet de nettoyer la peau sans l'agresser, d'éviter une délipidation excessive et de restaurer une bonne hydratation.

La présente invention sera mieux comprise à l'aide du complément de description qui va suivre, qui donne en exemple la préparation d'un savon liquide conforme à l'invention.

Il doit être bien entendu, toutefois, que ces exemples sont donnés uniquement à titre d'illustration de l'objet de l'invention, dont ils ne constituent en aucune manière une limitation.

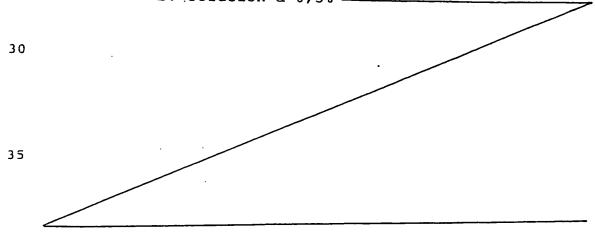


EXEMPLE 1 : Préparation d'une composition conforme à l'invention, destinée à être utilisée comme savon

5		TABLEAU 1			
	DENOMINATION COMMERCIALE	DENOMINATION CHIMIOUE	<b>&amp;</b>		
		CHILITOD	(p/p)		
	CETIOL HE	PEG-7-GLYCERYL COCOATE	1		
	TEXAPON N 40		9		
10	TEXAPON ASV	LAURYL ETHER SULFATE DE Na	9,5		
	GELIDERM 3000 S	DERIVE DE COLLAGENE ET	10		
		D'ACIDE GRAS			
	COMPERLAN KD	DIETHANOLAMIDE DE COPRAH	2		
	REWOTERIC AM2CNM	COCOAMPHOGLYCINATE	5		
15		GLYCERINE	7		
	VEEGUM HS		2		
	GLYDANT	DIMETHYL HYDANTOINE	0,3		
		CHLORURE DE Na	1		
	·	ACIDE CITRIQUE <sup>a</sup>	0,33		
20		VITAMINE E (MICRO-EMULSION)	2		
	ZINCOMADINE A 48 %	PYRITHIONE ZINC	0,5		
		PIROCTONE OLAMINE	0,3		
		PARFUM	0,02		
		COLORANT <sup>b</sup>	0,15		
25		EAU DEMINERALISEE	QSP 100		

a: solution à 10%

b: solution à 0,5% -



Le savon est préparé, à partir des composants indiqués au tableau I ci-dessus, selon la procédure suivante :

- on porte l'eau à ébullition dans une première cuve, et l'on maintient l'ébullition pendant 15 minutes ; après refroidissement à 60°C, on procède à la dissolution du chlorure de sodium et du glydant ;
- on introduit successivement, dans une deuxième cuve en inox, et sous agitation planétaire, les composants suivants : Geliderm 3000 S, Texapon ASV, Texapon N40, Glycérine, Veegum HS, Comperlan KD, Vitamine E, Cétiol HE, Rewoteric AM2CNM;
- on mélange le contenu des deux cuves, sous agitation modérée, et on refroidit à une température de
   25°C; on ajoute, sous agitation planétaire, la pyrithione zinc, et la piroctone olamine, on ajoute également, si on le souhaite, le parfum;
  - après complète dissolution, on ajuste le pH à 6 par addition de la solution d'acide citrique ;
- Si on le désire, on ajoute le colorant.

  Ainsi que cela ressort de ce qui précède,
  l'invention ne se limite nullement à ceux de ses modes de
  mise en oeuvre, de réalisation et d'application qui viennent d'être décrits de façon plus explicite ; elle en
  25 embrasse au contraire toutes les variantes qui peuvent
  venir à l'esprit du technicien en la matière, sans
  s'écarter du cadre, ni de la portée, de la présente
  invention.

## REVENDICATIONS

- 1) Composition antiacnéique, caractérisée en ce qu'elle comprend de la piroctone olamine, de la pyrithione zinc, et un tensio-actif amionique dérivé de collagène et d'acide gras.
- 2) Composition selon la revendication 1, 10 caractérisée en ce qu'elle comprend en outre un antioxydant.
  - 3) Composition selon la Revendication 2, caractérisée en ce que l'anti-oxydant est la vitamine E, sous forme de micro-émulsion.
- 15 4) Composition selon l'une quelconque des Revendications 1 à 3, caractérisée en ce qu'elle comprend, en outre, d'autres principes antifongiques, antiseptiques et/ou antiséborrhétiques
- 5) Composition selon l'une quelconque des 20 Revendications 1 à 4, caractérisée en ce qu'elle comprend entre 0,05 et 2%, en poids, de piroctone olamine, entre 0,1 et 3%, en poids, de pyrithione zinc, et entre 5 et 20 %, en poids, de dérivé de collagène et d'acide gras.
- 6) Composition selon l'une quelconque des 25 Revendications 2 à 5, caractérisée en ce qu'elle comprend de 0,5 à 10%, en poids, de vitamine E.
- Composition selon l'une quelconque des revendications 1 à 6, pour l'utilisation comme savon, ladite composition étant caractérisée en ce qu'elle comprend en outre une base lavante, au moins un agent 30 hydratant, humectant et/ou au moins un agent surgraissant, et, optionnellement des parfums, colorants, agents de texture, et conservateurs appropriés.
- 8) Composition selon la revendication 7, 35 caractérisée en ce que son pH est compris entre 4 et 7.
  - 9) Composition selon l'une quelconque des revendications 7 ou 8, caractérisée en ce qu'elle est

constituée par le mélange, dans une quantité d'eau appropriée, de : entre 0,5 et 2% en poids de pyrithione zinc, entre 0,3 et 1% en poids de piroctone olamine, entre 5 et 20 % en poids de dérivé de collagène et d'acide gras, entre 0,5 et 10% en poids de vitamine E, entre 1 et 10% en poids d'agents surgraissants, entre 1 et 10% en poids d'agents hydratants, entre 10 et 40% en poids de tensio-actifs anioniques et/ou de tensio actifs amphotères doux.

## REPUBLIQUE FRANÇAISE

INSTITUT NATIONAL

PROPRIETE INDUSTRIELLE

## RAPPORT DE RECHERCHE

établi sur la base des dernières revendications déposées avant le commencement de la recherche Nº d'enregistrement national

FR 9116406 FA 465811

X : parti Y : parti autri A : perti ou a	CATEGORIE DES DOCUMENTS CITES  iculièrement pertinent à lui seul iculièrement pertinent en combinaison avec un e document de la même catégorie inent à l'encontre d'au moins une revendication urrière-plan technologique général ilgation non-écrite	T: théorie ou princip. E: document de breve à la date de dépôt de dépôt ou qu'a t D: cité dans la dema. L: cité pour d'autres &: membre de la mér	rt bénéficiant d'i et qui n'a été p ine date postérie nde raisons	me date antérieure ublié qu'i cette date ure.
		AOUT 1992	SIER	RA GONZALEZ
		rement de la recherche		Exeminate
	* page 3, ligne 1 - ligne 15 *			DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHES (Int. Cl.5) A61K
Υ	<pre>* exemples 1-4 * * revendications 1-3,13,14,16-20 * FR-A-2 123 148 (M. CONTIER)  * page 1 - page 2, ligne 17 * * page 2, ligne 32 - ligne 40 *</pre>	·	1,2,4,5, 7	· ·
٧	FR-A-2 618 072 (L'OREAL)  * page 1 - page 5, ligne 12 *		1,2,4,5, 7	
x	EP-A-0 217 635 (THE PROCTER AND GAM* page 2, ligne 40 - ligne 63 * * page 3, ligne 1 - ligne 20 * * page 3, ligne 48 - ligne 65 * * revendications 1-3,10-14,21 *	IBLE COMPANY)	1,4,5,8	
Catégorie	Citation du document avec indication, en cas des parties pertinentes	s de besoin,	de la demande examinée	

1